

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
1 avril 2004 (01.04.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/026894 A3

(51) Classification internationale des brevets⁷ : C07K 9/00, A61K 38/04, G01N 33/68, C07K 7/64 (74) Mandataires : BREESÉ, Pierre etc.; 3, avenue de l'Opéra, F-75001 Paris (FR).

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/002773

(22) Date de dépôt international :
19 septembre 2003 (19.09.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0211614 19 septembre 2002 (19.09.2002) FR
60/411,845 19 septembre 2002 (19.09.2002) US

(71) Déposants (pour tous les États désignés sauf US) :
CENTRE NATIONAL DE LA RECHERCHE SCIENTIFIQUE - CNRS [FR/FR]; 3, rue Michel-Ange, F-75794 Paris Cedex 16 (FR). UNIVERSITE JOSEPH FOURIER [FR/FR]; Domaine Universitaire de Saint-Martin, d'Hérès, BP 53, F-38041 Grenoble Cedex 9 (FR). INSERM [FR/FR]; 101, rue de Tolbiac, F-75654 Paris Cedex 13 (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : DUMY, Pascal [FR/FR]; Chemin du Chaboud, F- 38580 Allevard (FR). FAVROT, Marie-Christine [FR/FR]; 1, avenue Branly, F- 38700 Corenc (FR). BOTURYN, Didier [FR/FR]; 20, rue du Docteur Greffier, F-38000 Grenoble (FR). COLL, Jean-Luc [FR/FR]; 5, allée du Pèle, F-Claix (FR).

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 24 juin 2004

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) Title: SYNTHESIS AND CHARACTERIZATION OF NOVEL SYSTEMS FOR GUIDANCE AND VECTORIZATION OF COMPOUNDS HAVING A THERAPEUTIC ACTIVITY

(54) Titre : SYNTHESE ET CARACTERISATION DE NOUVEAUX SYSTEMES DE GUIDAGE ET DE VECTORISATION DE COMPOSE DOUES D'ACTIVITE THERAPEUTIQUE

(57) Abstract: The invention relates to a method for preparing a grafted homodetic cyclopeptide forming a frame defining two surfaces, one surface being known as the upper surface and the other surface being known as the lower surface, both surfaces being grafted, characterized in the a linear peptide is synthesized, said synthesis being carried out on modified amino acids or not, some of which include orthogonal protector groups, intramolecular cyclization of the protected linear peptide thus obtained is performed, all or part of the orthogonal protector groups are substituted by a protected precursor, and at least one molecule of therapeutic interest is grafted on one and/or the other surface of the frame by means of an oxime link.

(57) Abrégé : La présente invention concerne un procédé de préparation d'un cyclopeptide homodétique greffé formant un châssis définissant deux faces, une face dite supérieure et une face dite inférieure, lesdites deux faces étant toutes les deux greffées, caractérisé en ce que l'on synthétise un peptide linéaire, ladite synthèse étant effectuée à partir d'acides aminés modifiés ou non, certains d'entre eux portant des groupes protecteurs orthogonaux, on effectue une cyclisation intramoléculaire du peptide protégé linéaire obtenu, on substitue tout ou partie des groupes protecteurs orthogonaux par un précurseur protégé, on greffe sur l'une et/ou l'autre face dudit châssis, par une liaison oxime, au moins une molécule d'intérêt.

WO 2004/026894 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/FR 03/02773

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07K9/00 A61K38/04 G01N33/68 C07K7/64

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07K A61K G01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	<p>P DUMY ET AL.: "A convenient synthesis of cyclic peptides as regioselectively addressable functionalized templates (RAFT)" TETRAHEDRON LETTERS., vol. 38, no. 8, 1995, pages 1255-1258, XP002251829 ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM., NL ISSN: 0040-4039 the whole document</p> <p style="text-align: center;">--- -/--</p>	1-35

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☐ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *g* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

26 April 2004

Date of mailing of the international search report

13/05/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Masturzo, P

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/FR 03/02773

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	F PERI ET AL.: "Chemo- and stereoselective glycosylation of hydroxylamino derivatives: a versatile approach to glycoconjugates" TETRAHEDRON., vol. 54, 1998, pages 12269-12278, XP002251830 ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM., NL ISSN: 0040-4020 the whole document	1-35
A	O RENAUDET & P DUMY: "Expedient synthesis of aminoxyolated-carbohydrates for chemoselective access of glycoconjugates" TETRAHEDRON LETTERS., vol. 42, 2001, pages 7575-7578, XP002251831 ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM., NL ISSN: 0040-4039 the whole document	1-35
P,X	O RENAUDET & P DUMY: "Chemoselectively template-assembled glycoconjugates as mimics for multivalent presentation of carbohydrates" ORGANIC LETTERS., vol. 5, no. 3, 2003, pages 243-246, XP002251832 ACS, WASHINGTON, DC., US ISSN: 1523-7060 the whole document	1-35
Y	D FORGET ET AL.: "3-oligonucleotides conjugation via chemoselective oxime bond formation" TETRAHEDRON LETTERS., vol. 42, no. 52, 2001, pages 9171-9174, XP004328105 ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM., NL ISSN: 0040-4039 the whole document	1-35

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

de Internationale No

PCT/FR 03/02773

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE

CIB 7 C07K9/00 A61K38/04 G01N33/68 C07K7/64

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)

CIB 7 C07K A61K G01N

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche.

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés)

CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie *	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
Y	<p>P DUMY ET AL.: "A convenient synthesis of cyclic peptides as regioselectively addressable functionalized templates (RAFT)"</p> <p>TETRAHEDRON LETTERS., vol. 38, no. 8, 1995, pages 1255-1258, XP002251829</p> <p>ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM., NL</p> <p>ISSN: 0040-4039</p> <p>le document en entier</p> <p style="text-align: center;">--- -/-</p>	1-35



Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents



Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe

* Catégories spéciales de documents cités:

- *A* document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent
- *E* document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date
- *L* document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)
- *O* document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens
- *P* document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée

T document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention

X document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément

Y document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier

Z document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

26 avril 2004

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

13/05/2004

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale

Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Masturzo, P

C.(suite) DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS		
Catégorie	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
Y	F PERI ET AL.: "Chemo- and stereoselective glycosylation of hydroxylamino derivatives: a versatile approach to glycoconjugates" TETRAHEDRON., vol. 54, 1998, pages 12269-12278, XP002251830 ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM., NL ISSN: 0040-4020 le document en entier	1-35
A	O RENAUDET & P DUMY: "Expedient synthesis of aminooxylated-carbohydrates for chemoselective access of glycoconjugates" TETRAHEDRON LETTERS., vol. 42, 2001, pages 7575-7578, XP002251831 ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM., NL ISSN: 0040-4039 le document en entier	1-35
P,X	O RENAUDET & P DUMY: "Chemoselectively template-assembled glycoconjugates as mimics for multivalent presentation of carbohydrates" ORGANIC LETTERS., vol. 5, no. 3, 2003, pages 243-246, XP002251832 ACS, WASHINGTON, DC., US ISSN: 1523-7060 le document en entier	1-35
Y	D FORGET ET AL. : "3-oligonucleotides conjugation via chemoselective oxime bond formation" TETRAHEDRON LETTERS., vol. 42, no. 52, 2001, pages 9171-9174, XP004328105 ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM., NL ISSN: 0040-4039 le document en entier	1-35